

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :  <b>A61K 7/48</b>	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 99/62478</b>  (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: <b>9. Dezember 1999 (09.12.99)</b>
		(21) Internationales Aktenzeichen: <b>PCT/EP99/03777</b>
		(22) Internationales Anmeldedatum: <b>1. Juni 1999 (01.06.99)</b>
		(30) Prioritätsdaten: <b>198 24 727.3 3. Juni 1998 (03.06.98) DE</b>
		(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): BEIERS-DORF AG [DE/DE]; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).
		(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): SCHREINER, Volker [DE/DE]; Eimsbütteler Chaussee 67, D-20259 Hamburg (DE). SCHÖNROCK, Uwe [DE/DE]; Lerchenweg 33, D-23866 Nahe (DE). STÄB, Franz [DE/DE]; Bäckerstrasse 3, D-21379 Echem (DE). MAX, Heiner [DE/DE]; Krochmannstrasse 82 b, D-22297 Hamburg (DE). SAND-HOFF, Konrad [DE/DE]; Auf dem Platt 12, D-53347 Alfter (DE). DÖRING, Thomas [DE/DE]; Kreuzfeldstrasse 12, D-53773 Hennef (DE).
		(74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).

(54) Title: COSMETIC OR DERMATOLOGIC PREPARATIONS CONTAINING CATECHINS OR GREEN TEA EXTRACT

(54) Bezeichnung: KOSMETISCHE ODER DERMATOLOGISCHE ZUBEREITUNGEN MIT EINEM GEHALT AN CATECHINEN ODER EINEM GEHALT AN EXTRAKT VON GRÜNEM TEE

## (57) Abstract

The invention relates to the use of catechins or bile acid esters of catechin or aqueous or organic extracts from plants or plant parts which contain catechins or bile acid esters of catechins, for example, of the leaves of the plant family Theaceae, especially of the species *Camellia sinensis* (green tea) or typical constituents thereof (such as, e.g. polyphenols or catechins, caffeine, vitamins, sugar, minerals, amino acids, lipids) for the prophylaxis, treatment and/or care of dry skin conditions.

## (57) Zusammenfassung

Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wässriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Republik Korea	RO	Rumänien		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LJ	Liechtenstein	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SG	Singapur		
EE	Estland	LR	Liberia				

### Beschreibung

#### **Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Catechinen oder einem Gehalt an Extrakt von grünem Tee**

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische bzw. dermatologische dermatologische Zubereitungen, enthaltend Wirkstoffe zur Pflege und zum Schutze der Haut, insbesondere der empfindlichen und trockenen Haut wie auch ganz besonders im Vordergrunde stehend der durch intrinsische und/oder extrinsische Faktoren gealterten oder alternden Haut sowie die Verwendung solcher Wirkstoffe und Kombinationen solcher Wirkstoffe auf dem Gebiete der kosmetischen und dermatologischen Hautpflege.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Die Hornschicht der Haut zeichnet sich durch eine besondere Struktur aus, die einerseits die Haut vor Verlust an lebenswichtigem Zellwasser bzw. dem Eindringen von externen Noxen schützt und andererseits ihre eigene Flexibilität durch Bindung einer definierten Wassermenge stabilisiert: Interzellularlipide, bestehend aus freien Sterolen und Fettsäuren sowie verschiedenen Ceramidklassen, bilden innerhalb der Horn-

schicht eine Barriere in Form extrazellulärer, multilamellarer und wasserundurchlässiger Membransysteme aus.

Die Lipidmembranen umlagern die abgestorbenen Korneozyten mit eingelagerten hygrokopischen Stoffen. Die Hornschicht befindet sich in einem ständigen Erneuerungsprozess, wobei nach außen kontinuierlich feine Schuppen (Korneozyten mit anhaftenden Lipiden) abgegeben und von innen verhorntes Zell- und Lipidmaterial nachproduziert wird. Im Gleichgewicht verursacht der Regenerationsprozess also keine Veränderung des transepidermalen Wasserverlustes.

Schon bei einem einfachen Wasserbad ohne Zusatz von Tensiden kommt es zunächst zu einer Quellung der Hornschicht der Haut, wobei der Grad dieser Quellung beispielsweise von der Dauer des Bades und dessen Temperatur abhängt. Zugleich werden wasserlösliche Stoffe, z.B. wasserlösliche Schmutzbestandteile, aber auch hauteigene Stoffe, die für das Wasserbindungsvermögen der Hornschicht verantwortlich sind, ab- bzw. ausgewaschen. Durch hauteigene oberflächenaktive Stoffe werden zudem auch Hautfette in gewissem Ausmaße gelöst und ausgewaschen. Dies bedingt nach anfänglicher Quellung eine nachfolgende deutliche Austrocknung der Haut, die durch waschaktive Zusätze noch verstärkt werden kann.

Bei gesunder Haut sind diese Vorgänge im allgemeinen belanglos, da die Schutzmechanismen der Haut solche leichten Störungen der oberen Hautschichten ohne weiteres kompensieren können. Aber bereits im Falle nichopathologischer Abweichungen vom Normalstatus, z.B. durch umweltbedingte Abnutzungsschäden bzw. Irritationen, Lichtschäden, Altershaut usw., ist der Schutzmechanismus der Hautoberfläche gestört. Unter Umständen ist er dann aus eigener Kraft nicht mehr imstande, seine Aufgabe zu erfüllen und muß durch externe Maßnahmen regeneriert werden.

Darüber hinaus ist bekannt, daß Lipidzusammensetzung und -menge der Hornschicht der pathologisch veränderten, trockenen und der trockenen, jedoch nicht erkrankten Haut jüngerer und älterer Menschen vom Normalzustand abweicht, der in der gesunden, normal hydrierten Haut einer gleichaltrigen Altersgruppe vorgefunden wird. Dabei stellen die Veränderungen im Lipidmuster der sehr trockenen, nicht-ekzematösen Haut von Patienten mit atopischem Ekzem einen Extremfall für die Abweichungen dar, die in der trockenen Haut gesunder Menschen vorgefunden werden.

Diese Abweichungen betreffen dabei ganz besonders die Ceramide, die in ihrer Menge stark reduziert und zusätzlich anders zusammengesetzt sind. Auffallend ist dabei in besonderer Weise das Defizit an den Ceramiden 1 und 3, wobei insbesondere für das Ceramid 1 bekannt ist, daß es in besonderer Weise die Ordnung der Lipide in den Interzellularmembransystemen steigert.

Nachteilige Veränderungen in den Lipidmembranen der vorab geschilderten Art beruhen möglicherweise auf fehlgesteuerter Lipidbiosynthese und erhöhen ebenfalls im Endeffekt den transepidermalen Wasserverlust. Eine langanhaltende Barriereförderung wiederum macht die an sich gesunde Haut empfindlicher und kann im Einzelfalle zum Entstehen ekzematöser Vorgänge in der kranken Haut beitragen.

Die Wirkung von Salben und Cremes auf Barrierefunktion und Hydratation der Hornschicht besteht in der Regel nicht in einer Wiederherstellung bzw. Stärkung der physikalisch-chemischen Eigenschaften der Lamellen aus Interzellulärlipiden. Ein wesentlicher Teileffekt beruht auf der bloßen Abdeckung der behandelten Hautbezirke und dem daraus resultierenden Wasserstau in der darunterliegenden Hornschicht. Coappilierte hygrokopische Substanzen binden das Wasser, so daß es zu einer meßbaren Zunahme des Wassergehaltes in der Hornschicht kommt. Diese rein physikalische Barriere kann jedoch relativ leicht wieder entfernt werden. Nach dem Absetzen des Produktes kehrt die Haut dann sehr schnell wieder den Zustand vor Behandlungsbeginn zurück. Darüber hinaus kann die Hautpflegewirkung bei regelmäßiger Behandlung nachlassen, so daß schließlich sogar während der Behandlung der Status quo wieder erreicht wird. Bei bestimmten Produkten verschlechtert sich der Zustand der Haut nach Absetzen unter Umständen vorübergehend. Eine nachhaltige Produktwirkung wird in der Regel also nicht oder nur in einem eingeschränkten Maße erreicht.

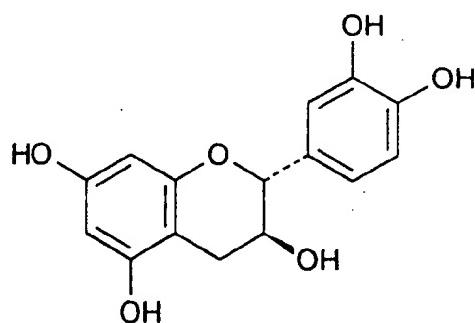
Um die defizitäre Haut bei ihrer natürlichen Regeneration zu unterstützen und ihre physiologische Funktion zu stärken, werden topischen Präparaten in neuerer Zeit zunehmend Interzellulär lipidmischungen zugesetzt, die von der Haut zum Wiederaufbau der natürlichen Barriere verwendet werden sollen. Allerdings handelt es sich bei diesen Lipiden, insbesondere aber den Ceramiden, um sehr teure Rohstoffe. Zudem ist ihre Wirkung meist sehr viel geringer als erhofft.

Ziel der vorliegenden Erfindung war es somit, Wege zu finden, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden. Insbesondere sollte die Wirkung der Hautpflegeprodukte physiologisch, schnell und nachhaltig sein.

Erfindungsgemäß werden diese Aufgaben gelöst durch Gegenstand der Erfindung sind ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wässriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.

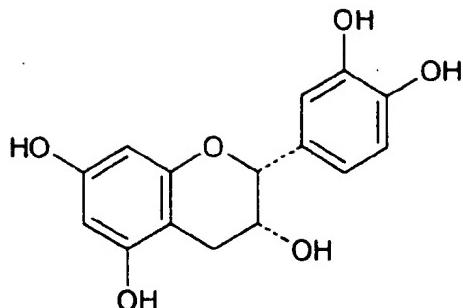
Catechine stellen eine Gruppe von Verbindungen dar, die als hydrierte Flavone oder Anthocyanidine aufzufassen sind. Die Catechine bilden die Grundsubstanz einer Reihe natürlicher oligo- oder polymerer Gerbstoffe, z. B. im Tee. Sie kommen zusammen mit anderen Phenolen in vielen Obstarten vor und sind an der durch Phenoloxidasen katalysierten Bräunung von Druck- und Schnittstellen (z. B. bei Äpfeln) beteiligt.

Der Grundkörper, das „Catechin“ (Catechol, 3,3',4',5,7-Flavanpentaol, 2-(3,4-Dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) ist weitverbreitet in Pflanzen und kommt beispielsweise im Catechu vor. Es ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Das Epicatechin ((2R,3R)-3,3',4',5,7-Flavanpentaol) stellt ein Epimeres des Catechins dar und ist durch die Strukturformel



gekennzeichnet.

Die erfindungsgemäßen Aufgaben werden ebenfalls gelöst durch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solche Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

Tee stammt ausschließlich aus Blättern, Blattknospen und zarten Stielen des Teestrauches (*Camellia sinensis* L.), die nach Verfahren wie Welken, Rollen, Fermentieren, Zerkleinern und Trocknen bearbeitet werden. Schwarzer Tee ist ein fermentierter Tee, Oolong-Tee ist ein halb fermentierter Tee, dessen Blätter nach Welken u. Rollen nur die Hälfte der sonst üblichen Zeit fermentiert und anschließend getrocknet werden. Grüner Tee ist ein unfermentiertes Erzeugnis, dessen Blätter blanchiert, gerollt und unter Erhalt der natürlichen Blattfarbstoffe getrocknet werden.

Die Zusammensetzung der Inhaltsstoffe der Teeblätter schwankt je nach Herkunft und Behandlung beträchtlich. Im Durchschnitt enthält schwarzer Tee 18,9% Catechine und Catechin-Gerbstoffe, 16,6% Proteine, 2,7% Coffein, 10,2% andere Stickstoffverbindungen, 4,6% Oligosaccharide, 0,6% Stärke, 11,9% Pektin, 7,9% Cellulose und 6,1% Lignin. Frische Blätter weisen im wesentlichen die gleiche Zusammensetzung auf, enthalten jedoch mehr Catechine (26%), weniger Stickstoffverbindungen (8,7%, bei gleichem Coffein-Gehalt) sowie 0,8% Inosit. In den Polyphenol-Gerbstoffen finden sich zu etwa 80% Catechine (Hauptbestandteil Galloyl(-)-epigallocatechin).

Überraschenderweise wurde gefunden, daß Extrakte aus Blättern der Pflanzen der Ordnung Theales mit der Familie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia* spec., ganz besonders der Teesorten *Camellia sinensis*, *C. assamica*, *C. taliensis* bzw. *C. irrawadiensis* und Kreuzungen aus diesen mit beispielsweise *Camellia japonica* die

Syntheserate der Ceramide in der menschlichen Haut generell, insbesondere aber die Syntheserate der Ceramide 1, 2 und 3 um ein Vielfaches erhöhen.

Außer den Catechinen (beispielsweise Catechin und Epicatechin) enthält grüner Tee ferner die Gallensäureester dieser Wirkstoffe, welche ebenfalls erfindungsgemäß wirksam sind.

Gegenstand der Erfindung ist ferner die Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (Grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Stimulierung der Sphingolipidsynthese bzw. zur Stärkung der Lipidbarriere der menschlichen Haut.

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Hautpflegeprodukte 0,0001 - 20 Gewichtsprozente an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, vorzugsweise Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechingallat, (-)-Gallocatechingallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechin Gallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechingallat.

Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,001 - 10 Gew.-% an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Ganz besonders bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,01 - 1 Gew.-% an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder an wäßrigen bzw. organischen Extrakten aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

Die erfindungsgemäßen topischen Zubereitungen können als flüssige, pastöse oder feste Zubereitungen formuliert werden, beispielsweise als wäßrige oder alkoholische Lösungen, wäßrige Suspensionen, Emulsionen, Salben, Cremes, Gele, Öle, Pulver oder Stifte. In Abhängigkeit von der gewünschten Formulierung können Wirkstoffe in pharmazeutische und kosmetische Grundlagen für topische Applikationen eingearbeitet werden, die als weitere Komponenten beispielsweise Ölkomponenten, Fett und Wachse, Emulgatoren, anionische, kationische, ampholytische, zwitterionische und/oder nichtionogene Tenside, niedere ein- und mehrwertige Alkohole, Wasser, Konservierungsmittel, Puffersubstanzen, Verdickungsmittel, Duftstoffe, Farbstoffe und Trübungsmittel enthalten. Vorteilhaft können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch in transdermalen therapeutischen Systemen, insbesondere kubischen Systemen verwendet werden.

Es ist von Vorteil, den pflegenden topischen Zubereitungen Zusatzstoffe wie Vitamine, Coenzyme, Substrate und Hilfsfaktoren des Lipidstoffwechsels oder des Energiestoffwechsels oder sonstige kosmetische oder dermatologische Hilfs- oder Wirkstoffe zuzusetzen, beispielsweise Pyridoxin, Pyridoxal, Pyridoxamin, Uridin, L-Serin, schwache Carbonsäuren, deren pK<sub>s</sub>-Wert zwischen 3 und 5,5 liegt (z.B. Milchsäure und Propionsäure), Citronensäure, Pyruvat sowie zelluläre Energieüberträger (z.B. Kreatin, Guanin, Guanosin, Adenin, Adenosin, Nicotin, Nicotinamid, Riboflavin), Coenzyme (z.B. Coenzym Q<sub>10</sub>, Pantothensäure, Panthenol, Liponsäure), Hilfsfaktoren (z.B. L-Carnitin), Substrate (z.B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Taurocholsäure, Lipide (z.B. Ceramide, Cholesterin, Fettsäuren, Sphinosin, Sphingomyelin, Glucocerebroside), Substrate (z.B. Hexosen, Pentosen, Fettsäuren), Glutathion und/oder natürliche Befeuchtungsfaktoren (z.B. Aminosäuren, Harnstoff, Pyrrolidoncarbonsäure, Glycerin).

Es ist auch von Vorteil, den erfindungsgemäßen Zubereitungen Antioxidantien zuzusetzen. Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α-Carotin, β-Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ-Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodi-

propionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxsäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate,  $\alpha$ -Glycosyrlutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophonen, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UV-A-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UV-B-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z.B. in Tagescremes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen außerdem Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 6,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen UVB-Filtersubstanzen, können diese öllöslich oder wasserlöslich sein. Erfindungsgemäß vorteilhafte öllösliche UVB-Filter sind z.B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure-(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester,
- Derivate des 1,3,5-Triazins, vorzugsweise 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, erfindungsgemäße Zubereitungen mit UVA-Filtern zu formulieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert.Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion.

Gegenstand der Erfindung sind also auch die Kombinationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, insbesondere in den topischen Zubereitungen, mit Antioxidantien, Stoffen des aeroben zellulären Energiestoffwechsels und/oder UV-Absorbern, durch die sich z.B. die Stabilität und die Wirkung der Zubereitung verbessern läßt.

Die vorstehend aufgeführten Beispiele für kombinierbare Wirkstoffe aus den angegebenen Wirkstoffgruppen dienen dazu, die Erfindung zu beschreiben, ohne daß beabsichtigt ist, die Erfindung auf diese Beispiele zu beschränken.

Darüber hinaus können schützende Formulierungsformen angewendet werden, wobei die erfindungsgemäßen Stoffe z.B. in Liposomen, Micellen, Nanosphären usw. aus z.B. hydrierten Amphiphilen, wie z.B. Ceramiden, Fettsäuren, Sphingomyelin und Phosphoglyceriden bzw. in Cyclodextrane eingeschlossen (verkapselt) werden. Weiterer Schutz kann durch die Verwendung von Schutzgas (z.B. N<sub>2</sub>, CO<sub>2</sub>) bei der Formulierung und die Verwendung gasdichter Verpackungsformen erreicht werden.

Weitere Hilfs- und Zusatzstoffe können wasserbindende Stoffe, Verdicker, Füllstoffe, Parfüm, Farbstoffe, Emulgatoren, Wirkstoffe wie Vitamine, Konservierungsmittel, Wasser und/oder Salze sein.

Die erfindungsgemäßen Stoffgruppen lassen sich in alle kosmetischen Grundlagen einarbeiten. Grundsätzlich sind allerdings W/O- und O/W- und W/O/W-Emulsionen, Hydrodispersionen und Lipodispersionen bevorzugt. Besonders vorteilhaft können erfindungsgemäße Kombinationen in Pflegeprodukte wie beispielsweise O/W-Cremes, W/O-Cremes, O/W-Lotionen usw. eingesetzt werden.

Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachse
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkan-säuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;

- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyoleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silkonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die wässrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft

- Alkohole, Diole oder Polyoole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethyl-ether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z.B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Im technischen Sinne werden unter Gelen verstanden: Relativ formbeständige, leicht verformbare disperse Systeme aus zumindest zwei Komponenten, welche in der Regel aus einem - meist festen - kolloidal zerteilten Stoff aus langkettigen Molekülgruppierungen (z.B. Gelatine, Kieselsäure, Polysaccharide) als Gerüstbildner und einem flüssigen Dispersionsmittel (z.B. Wasser) bestehen. Der kolloidal zerteilte Stoff wird oft als Verdickungs- oder Geliermittel bezeichnet. Er bildet ein räumliches Netzwerk im Dispersionsmittel, wobei einzelne kolloidal vorliegende Partikel über elektrostatische Wechselwirkung miteinander mehr oder weniger fest verknüpft sein können. Das Dispersionsmittel, welches das Netzwerk umgibt, zeichnet sich durch elektrostatische Affinität zum Geliermittel aus, d.h., ein vorwiegend polares (insbesondere: hydrophiles) Geliermittel giert vorzugsweise ein polares Dispersionsmittel (insbesondere: Wasser), wohingegen ein vorwiegend unpolares Geliermittel vorzugsweise unpolare Dispersionsmittel giert.

Starke elektrostatische Wechselwirkungen, welche beispielsweise in Wasserstoffbrückenbindungen zwischen Geliermittel und Dispersionsmittel, aber auch zwischen Dispersionsmittelmolekülen untereinander verwirklicht sind, können zu starker Vernetzung auch des Dispersionsmittels führen. Hydrogele können zu fast 100 % aus Wasser bestehen (neben beispielsweise ca. 0,2 - 1,0 % eines Geliermittels) und dabei durchaus feste Konsistenz besitzen. Der Wasseranteil liegt dabei in eisähnlichen Strukturelementen vor, so daß Gele daher ihrer Namensherkunft [aus lat. „gelatum“ = „Gefrorenes“ über den alchimistischen Ausdruck „gelatina“ (16. Jhd.) für nhdt. „Gelatine“] durchaus gerecht werden.

Gele gemäß der Erfindung enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

Zubereitungen gemäß der Erfindung können beispielsweise auch als Schaum- und Duschbäder, feste und flüssige Seifen oder sogenannte "Syndets" (synthetische Detergentien), Shampoos, Handwaschpasten, Intimwaschmittel, spezielle Reinigungsmittel für Kleinkinder und dergleichen ausgestaltet werden.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können sich gegebenenfalls vorteilhaft durch einen Gehalt an Tensiden auszeichnen. Tenside sind amphiphile Stoffe, die organische, unpolare Substanzen in Wasser lösen können. Sie sorgen, bedingt durch ihren spezifischen Molekülaufbau mit mindestens einem hydrophilen und einem hydrophoben Molekülteil, für eine Herabsetzung der Oberflächenspannung des Wassers, die Benetzung der Haut, die Erleichterung der Schmutzentfernung und -lösung, ein leichtes Abspülen und – je nach Wunsch – für Schaumregulierung.

Bei den hydrophilen Anteilen eines Tensidmoleküls handelt es sich meist um polare funktionelle Gruppen, beispielsweise  $-COO^-$ ,  $-OSO_3^{2-}$ ,  $-SO_3^-$ , während die hydrophoben Teile in der Regel unpolare Kohlenwasserstoffreste darstellen. Tenside werden im allgemeinen nach Art und Ladung des hydrophilen Molekülteils klassifiziert. Hierbei können vier Gruppen unterschieden werden:

- anionische Tenside,
- kationische Tenside,
- amphotere Tenside und
- nichtionische Tenside.

Anionische Tenside weisen als funktionelle Gruppen in der Regel Carboxylat-, Sulfat- oder Sulfonatgruppen auf. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu negativ geladene organische Ionen. Kationische Tenside sind beinahe ausschließlich durch das Vorhandensein einer quaternären Ammoniumgruppe gekennzeichnet. In wäßriger Lösung bilden sie im sauren oder neutralen Milieu positiv geladene organische Ionen. Amphotere Tenside enthalten sowohl anionische als auch kationische Gruppen und verhalten sich demnach in wäßriger Lösung je nach pH-Wert wie anionische oder kationische Tenside. Im stark sauren Milieu besitzen sie eine positive und im alkalischen Milieu eine negative Ladung. Im neutralen pH-Bereich hingegen sind sie zwitterionisch, wie das folgende Beispiel verdeutlichen soll:



$X^-$  = beliebiges Anion, z.B.  $Cl^-$



$B^+$  = beliebiges Kation, z.B.  $Na^+$

Typisch für nicht-ionische Tenside sind Polyether-Ketten. Nicht-ionische Tenside bilden in wäßrigem Medium keine Ionen.

#### A. Anionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende anionische Tenside sind

Acylaminosäuren (und deren Salze), wie

1. Acylglutamate, beispielsweise Natriumacylglutamat, Di-TEA-palmitoylaspartat und Natrium Caprylic/ Capric Glutamat,
2. Acylpeptide, beispielsweise Palmitoyl-hydrolysiertes Milchprotein, Natrium Coco-yl-hydrolysiertes Soja Protein und Natrium-/ Kalium Cocoyl-hydrolysiertes Kolla-gen,
3. Sarcosinate, beispielsweise Myristoyl Sarcosin, TEA-lauroyl Sarcosinat, Natri-umlauroylsarcosinat und Natriumcocoylsarkosinat,
4. Taurate, beispielsweise Natriumlauroyltaurat und Natriummethylcocoyltaurat,
5. AcylLactylate, lauroylactylat, Caproyllactylat
6. Alaninate

Carbonsäuren und Derivate, wie

1. Carbonsäuren, beispielsweise Laurinsäure, Aluminiumstearat, Magnesiumalka-nolat und Zinkundecylenat,
2. Ester-Carbonsäuren, beispielsweise Calciumstearoyllactylat, Laureth-6 Citrat und Natrium PEG-4 Lauramidcarboxylat,
3. Ether-Carbonsäuren, beispielsweise Natriumlaureth-13 Carboxylat und Natrium PEG-6 Cocamide Carboxylat,

Phosphorsäureester und Salze, wie beispielsweise DEA-Oleth-10-Phosphat und Di-laureth-4 Phosphat,

Sulfonsäuren und Salze, wie

1. Acyl-isethionate, z.B. Natrium-/ Ammoniumcocoyl-isethionat,
2. Alkylarylsulfonate,
3. Alkylsulfonate, beispielsweise Natriumcocosmonoglyceridsulfat, Natrium C<sub>12-14</sub> Olefin-sulfonat, Natriumlaurylsulfoacetat und Magnesium PEG-3 Cocamidsulfat,
4. Sulfosuccinate, beispielsweise Dioctylnatriumsulfosuccinat, Dinatriumlaurethsul-fosuccinat, Dinatriumlaurylsulfosuccinat und Dinatriumundecylenamido MEA-Sulfosuccinat

sowie

Schwefelsäureester, wie

1. Alkylethersulfat, beispielsweise Natrium-, Ammonium-, Magnesium-, MIPA-, Ti-PA- Laurethsulfat, Natriummyrethsulfat und Natrium C<sub>12-13</sub> Parethsulfat,
2. Alkylsulfate, beispielsweise Natrium-, Ammonium- und TEA- Laurylsulfat.

#### B. Kationische Tenside

Gegebenenfalls vorteilhaft zu verwendende kationische Tenside sind

1. Alkylamine,
2. Alkylimidazole,
3. Ethoxylierte Amine und
4. Quaternäre Tenside.
5. Esterquats

Quaternäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropyl-hydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzylidimethylstearylammmoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammmoniumsalze, beispielsweise beispielsweise Cetyltrimethylammnoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammnoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammnoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammnoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethyldimethylaminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammnoniumsalze zu verwenden.

#### C. Amphotere Tenside

Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind

1. Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiacetat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiacetat und Natriumacylamphopropionat,
2. N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

#### D. Nicht-ionische Tenside

Vorteilhaft zu verwendende nicht-ionische Tenside sind

1. Alkohole,
2. Alkanolamide, wie Cocamide MEA/ DEA/ MIPA,
3. Aminoxide, wie Cocoamidopropylaminoxid,
4. Ester, die durch Veresterung von Carbonsäuren mit Ethylenoxid, Glycerin, Sorbitan oder anderen Alkoholen entstehen,
5. Ether, beispielsweise ethoxylierte/propoxylerte Alkohole, ethoxylierte/ propoxylerte Ester, ethoxylierte/ propoxylerte Glycerinester, ethoxylierte/ propoxylerte Cholesterine, ethoxylierte/ propoxylerte Triglyceridester, ethoxyliertes propoxyliertes Lanolin, ethoxylierte/ propoxylerte Polysiloxane, propoxylierte POE-Ether und Alkylpolyglycoside wie Laurylglucosid, Decylglycosid und Cocoglycosid.
6. Sucroseester, -Ether
7. Polyglycerinester, Diglycerinester, Monoglycerinester
8. Methylglucosester, Ester von Hydroxysäuren

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen. Mengenangaben, Prozentangaben oder Teile beziehen sich, soweit nicht anders angegebene, auf das Gewicht, insbesondere auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen oder der jeweiligen Mischung.

**Beispiel 1**

Hautcreme vom W/O-Typ

	Gew.-%
Vaseline DAB 9	13,0
Glycerin DAB 9	6,30
Paraffinöl	40,80
Cetylstearylalkohol/PEG-40-Ricinusöl/Natriumcetyl stearylsulfat (Eutanol® G, Henkel KGaA)	2,50
Extrakt von grünem Tee	3,00
Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Wasser	ad 100,00

Der Extrakt von grünem Tee wird in die Wasserphase eingerührt. Die Fettphase wird zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

**Beispiel 2**

Hautcreme vom W/O-Typ

	Gew.-%
PEG-1 Glyceryl-Oleostearat + Paraffinwachs	8,00
Vaseline DAB	2,80
Paraffinwachs/Paraffin	1,80
Paraffinöl	12,00
Ceresin	2,20
Octyldodecanol	10,00
Propylenglycol	1,00
Glycerin	1,00
Magnesiumsulfat	0,70
Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Wasser VES	ad 100,00

Der Extrakt von grünem Tee wird in die Wasserphase eingerührt. Die Fettphase wird zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

**Beispiel 3**

Hautcreme vom O/W-Typ

	Gew.-%
Octyldodecanol (Emulgade ® F, Henkel KGaA)	9,30
Cetearylalkohol/PEG-40-Paraffinöl	7,80
Ricinusöl/Natriumcetearylsulfat (Eutanol ® G, Henkel KGaA)	3,70
(-)Epigallocatechin Gallat	1,00
Glycerin DAB 9	4,50
Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Wasser VES	ad 100,00

(-)Epigallocatechin Gallat wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird zu der 75°C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Creme entstanden ist.

**Beispiel 4**

O/W-Lotion

	Gew.-%
Steareth-2	3,00
Steareth-21	2,00
Cetylstearylalkohol/TEG-40-Ricinusöl/Natriumcetylstearylsulfat (Eutanol ® G, Henkel KGaA)	2,50
Paraffinöl	15,00
Propylenglycol	1,00
Glycerin	3,00
(-)Catechin	1,20
Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Wasser VES	ad 100,00

(-)Catechin wird in der Wasserphase gelöst. Die Fettphase wird sodann zu der 75°C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige hellgelbe Lotion entstanden ist.

**Beispiel 5**

## O/W-Lotion

	Gew.-%
Octyldodecanol (Emulgade F, Henkel KGaA)	5,60
Cetylstearylalkohol/TEG-40-Ricinusöl/Natriumcetylstearylsulfat (Eutanol ® G, Henkel KGaA)	8,90
Cetearylisononanoat (Cetiol® 5N, Henkel KGaA)	7,50
Paraffinöl	10,50
(-)-Gallocatechin Gallat	5,00
Glycerin DAB 9	4,70
Parfum, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Wasser VES	ad 100,00

(-)-Gallocatechin Gallat wird in der Wasserphase gelöst, Die Fettphase wird sodann zu der 75° C warmen Wasserphase gegeben, verrührt und homogenisiert, bis eine gleichmäßige Emulsion entstanden ist.

**Beispiel 6**

## Hautöl

	Gew.-%
Glyceryltricaprylat (Miglyol ® 812, Dynamit Nobel)	21,00
Hexyllaurat (Cetiol ® A, Henkel KGaA)	20,00
Octylstearat (Cetiol ® 886, Henkel KGaA)	20,00
Paraffinöl	36,00
Extrakt von grünem Tee	3,00

Die Komponenten werden bei 25° C verrührt, bis eine gleichmäßige, klare Mischung entstanden ist.

**Patentansprüche:**

1. Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Prophylaxe, Behandlung und/oder Pflege trockener Hautzustände.
2. Verwendung von Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen oder wäßriger bzw. organischer Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (Grüner Tee) bzw. deren typische Inhaltsstoffe (wie z.B. Polyphenole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide), zur Stimulation der Sphingolipidsynthese bzw. zur Stärkung der Lipidbarriere der menschlichen Haut.
3. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß das oder die Catechine gewählt wird oder werden aus der Gruppe (-)-Catechin, (+)-Catechin, (-)-Catechin Gallat, (-)-Gallocatechin Gallat, (+)-Epicatechin, (-)-Epicatechin, (-)-Epicatechin Gallat, (-)-Epigallocatechin, (-)-Epigallocatechin Gallat.
4. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2, in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen enthaltend pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere solchen Zubereitungen, die Extrakte des grünen Tees enthalten.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/03777

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

IPC 6 A61K7/48

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>DE 196 27 344 A (VITASYN GMBH ENTWICKLUNG &amp; VERTRIEB PHARMAZEUTISCHER PRODUKTE) 8 January 1998 (1998-01-08) the whole document ----</p> <p>WO 98 10739 A (E-L MANAGEMENT CORPORATION ET AL.) 19 March 1998 (1998-03-19) page 4, line 8 - line 31 -----</p>	



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 October 1999

Date of mailing of the international search report

18/10/1999

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Alvarez Alvarez, C

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/03777

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
DE 19627344 A	08-01-1998	DE	29623606 U	10-06-1999
WO 9810739 A	19-03-1998	US AU	5855897 A 4481897 A	05-01-1999 02-04-1998

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/03777

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
IPK 6 A61K7/48

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 6 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	DE 196 27 344 A (VITASYN GMBH ENTWICKLUNG & VERTRIEB PHARMAZEUTISCHER PRODUKTE) 8. Januar 1998 (1998-01-08) das ganze Dokument ----	
A	WO 98 10739 A (E-L MANAGEMENT CORPORATION ET AL.) 19. März 1998 (1998-03-19) Seite 4, Zeile 8 - Zeile 31 ----	

<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
11. Oktober 1999	18/10/1999
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Alvarez Alvarez, C

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/03777

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
DE 19627344 A	08-01-1998	DE	29623606 U	10-06-1999
WO 9810739 A	19-03-1998	US	5855897 A	05-01-1999
		AU	4481897 A	02-04-1998